

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-182344

(43) 公開日 平成10年(1998) 7月7日

| (51) Int.Cl. ⁹ | 識別記号 | F I | |
|------------------------------|------|---------------|---|
| A 6 1 K 7/00 | | A 6 1 K 7/00 | W |
| | | | N |
| A 0 1 N 37/18 | | A 0 1 N 37/18 | Z |
| A 6 1 K 7/42 | | A 6 1 K 7/42 | |
| B 0 1 J 13/00 | | B 0 1 J 13/00 | A |
| 審査請求 未請求 請求項の数 2 F D (全 6 頁) | | | |

(21) 出願番号 特願平8-356993
(22) 出願日 平成8年(1996)12月26日

(71) 出願人 000145862
株式会社コーセー
東京都中央区日本橋3丁目6番2号
(72) 発明者 稲川 敬
東京都北区栄町48番18号 株式会社コーセー
一研究所内

(54) 【発明の名称】 水中油型皮膚外用剤

(57) 【要約】

【課題】 刺咬性害虫の忌避効果、紫外線遮蔽効果に優れ、安定性並びに官能特性の良好な水中油型皮膚外用剤を提供する。

【解決手段】 刺咬性害虫の忌避成分1～20重量%、紫外線散乱剤1～15重量%、HLB8以上の親水性界面活性剤0.1～15重量%及び高級アルコール0.1～10重量%を含有することを特徴とする水中油型皮膚外用剤。

【特許請求の範囲】

【請求項1】次の成分(A)～(D)；

(A) 刺咬性害虫の忌避成分 1～20重量%

(B) 紫外線散乱剤 1～15重量%

(C) HLB8以上の親水性界面活性剤 0.1～15重量%

(D) 高級アルコール 0.1～10重量%
を含有することを特徴とする水中油型皮膚外用剤。

【請求項2】(A)成分の刺咬性害虫の忌避成分がN,N-ジエチル-m-トルアミドであることを特徴とする請求項1記載の水中油型皮膚外用剤。

【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、外気に曝された皮膚面に適用する皮膚外用剤に関し、さらに詳細には、刺咬性害虫の忌避成分と紫外線散乱剤とHLB8以上の親水性界面活性剤と高級アルコールとを配合した水中油型皮膚外用剤に関する。本発明の皮膚外用剤は、害虫の忌避効果のみならず、日焼け防止効果に優れ、かつ、皮膚に対して安全で、優れた官能特性を示す。

【0002】

【従来の技術】近年、皮膚に対する紫外線の悪影響に対する研究が進み、これを防御するため各種の紫外線吸収剤や紫外線散乱剤が開発されるとともに、これらを配合した化粧品や皮膚外用剤が数多く市販されている。これらの化粧品は、紫外線防御を目的とするため、太陽光線下に曝される皮膚に塗布して使用されるものである。これらはいずれも日中、海や山で利用されるものであるが、特にキャンプ地等の山林や森林で使用される場合には、同時に刺咬性害虫、例えば、蚊、ノミ、ダニ、アブ、ブヨ、サシバエ、シラミ等の攻撃を受けやすい。そこで、これらの外界の刺激から皮膚を防御するために、刺咬性害虫の忌避成分と紫外線吸収剤とを配合した外用剤が提案されている(特開平5-92915号及び特開平5-170603号)。一方、特開平8-183720号には、刺咬性害虫の忌避成分と紫外線散乱剤とを配合した油中水型の外用剤が例示されている。

【0003】

【発明が解決しようとする課題】しかしながら、刺咬性害虫の忌避成分や紫外線吸収剤は、効果発現のために多量配合した場合、経皮吸収という観点から鑑みて皮膚安全性上好ましいものではない。一方、刺咬性害虫の忌避成分と紫外線散乱剤を配合した油中水型の外用剤は、皮膚安全性上好ましいものの、その特性上、べたつき感や伸びの悪さ等の使用感の悪化を生じることがあった。したがって、日焼け防止効果と害虫忌避効果を兼ね備え、かつ、皮膚に安全で官能特性をも満足し得る皮膚外用剤の開発が望まれていた。

【0004】

【課題を解決するための手段】本発明者は上記実情に鑑

み、鋭意研究を行った結果、刺咬性害虫の忌避成分と特定成分とを配合した水中油型皮膚外用剤は、害虫の忌避効果を有するばかりでなく、日焼けを防止する特性を示し、さらに、官能特性においても優れた特性を示すことを見い出した。また、この場合、紫外線散乱剤として粉体を用いているため、日焼けを防止するという通常の効果の他に、皮膚上に刺咬性害虫の忌避成分と粉体が混在して留まるため、経皮吸収を抑制し、安全性を保ちながら忌避効果が長く持続するという効果をも見出し、本発明を完成するに至った。すなわち、本発明は、次の成分(A)～(D)；

(A) 刺咬性害虫の忌避成分 1～20重量%

(B) 紫外線散乱剤 1～15重量%

(C) HLB8以上の親水性界面活性剤 0.1～15重量%

(D) 高級アルコール 0.1～10重量%
を含有することを特徴とする水中油型皮膚外用剤である。以下、詳細に説明する。

【0005】

【発明の実施の形態】本発明に用いられる(A)成分である刺咬性害虫の忌避成分としては、例えば、N,N-ジエチル-m-トルアミド、ジメチルフタレート、ジブチルフタレート、2-エチル-1,3-ヘキサジオール、2,3,4,5-ビス(Δ²-ブチレン)テトラヒドロフルフラール、イソシンコメロネート、ジ-m-ブチルサクシネート、フェノトリン、ベンジルベンゾエート等が挙げられ、これらの一種又は二種以上を適宜選択して用いることができる。これらの中で、特に、N,N-ジエチル-m-トルアミド(以下、「DEET」と称する)が好ましい。これらの忌避成分の含有量は、1～20重量%(以下、単に「%」と記す)であり、より好ましくは、1～15%である。1%未満では良好な忌避効果を得ることが困難であり、また、20%を超えて配合した場合、使用性及び安全性の観点から好ましくない。

【0006】(B)成分である紫外線散乱剤としては、例えば、酸化チタン、酸化亜鉛、酸化ジルコニウム、酸化セレン、鉄等の他金属含有酸化チタン等の粉体が挙げられ、これらの一種又は二種以上を適宜選択して用いることができる。好ましくは、平均粒子径が0.1μm以下の微粒子酸化チタンや微粒子酸化亜鉛、長径0.05～0.5μm、短径0.01～0.1μmの紡錘状酸化チタンである。さらには、これらの紫外線散乱剤を表面処理したものをを用いてもよい。表面処理としては、金属石鹸処理、シリコーン処理、ジアルキルリン酸処理、パーフルオロアルキル基を有する化合物処理、アミノ酸処理、レシチン処理、コラーゲン処理等が挙げられ、就中、シリコーン処理、パーフルオロアルキル基を有する化合物処理が好ましい。これらの紫外線散乱剤の配合量は、1～15%であり、より好ましくは、1～12%で

ある。1%未満では良好な日焼け止め効果が得られず、また、15%を超えて配合した場合、良好な官能特性が得られないばかりでなく、分離等を生じ、経時での安定性を維持できない。

【0007】(C)成分のHLB8以上の親水性界面活性剤としては、陰イオン界面活性剤、陽イオン界面活性剤、非イオン性界面活性剤が挙げられるが、これらのうち、陰イオン界面活性剤とポリオキシエチレン（以下、「POE」と記す）付加型非イオン性界面活性剤が好ましい。陰イオン界面活性剤としては、例えば、N-アシルアミノ酸塩、アルキル硫酸塩、高級脂肪酸塩、POEアルキルエーテルリン酸塩（EO6～10モル付加）等を挙げることができる。このうち、ステアリン酸塩等の高級脂肪酸塩が特に好ましい。POE付加型非イオン性界面活性剤としては、例えば、POEアルキルエーテル型であるPOEオレイルエーテル（EO10～50モル付加）やPOEセチルエーテル（EO10～30モル付加）、POEソルビタンエステル型であるPOEソルビタンモノオレート（EO20～30モル付加）やPOEソルビタンモノイソステアレート（EO10～30モル付加）、POEヒマシ油誘導体（EO20～100モル付加）等を挙げることができる。上記界面活性剤は、単独で用いることも、また、二種以上を併用して用いることも可能であるが、陰イオン性界面活性剤とPOE付加型非イオン性界面活性剤とを併用することが好ましい。HLB8以上の親水性界面活性剤の配合量は、0.1～15%であり、より好ましくは、0.5～12%である。0.1%未満では、良好な乳化状態を得ることが困難であり、また、15%を超えて配合した場合、使用性面でべたつき等を生じ、好ましくない。

【0008】(D)成分の高級アルコールは、一般には乳化助剤又は両親媒性物質といわれているものであり、

通常、炭素鎖長が16以上のもの、すなわち、セチルアルコール、ステアリルアルコール、ベヘニルアルコール等を挙げることができる。これらは単独で用いることも、また、二種以上を併用して用いることもできる。高級アルコールの配合量は、0.1～10%である。0.1%未満では、乳化助剤としての効果が十分に発現せず、また、10%を超えて配合した場合、経時的に結晶等を析出したり、伸びの重さを生じる等好ましくない。

【0009】さらに、本発明の水中油型皮膚外用剤には、前記必須成分の他に、有機及び無機粉体、HLB8未満の親油性界面活性剤、エタノール等の低級アルコール類、多価アルコール等の保湿剤、油性成分、シリコン類、水溶性高分子、ゲル化剤、防腐剤、香料、色素、美容成分等を本発明の効果を損なわない範囲で配合することができる。

【0010】本発明の水中油型皮膚外用剤は、刺咬性害虫の忌避成分と紫外線散乱剤とを含有するので、日焼け止め化粧料や刺咬性害虫忌避剤として特に有用であり、形態としては、乳液、クリーム等の基礎化粧料や外用剤、リキッドファンデーション等のメーキャップ化粧料等、種々の形態で用いることができる。

【0011】

【実施例】以下に、実施例を挙げて本発明をより詳細に説明するが、本発明はこれらにより限定されるものではない。

【0012】実施例1～5及び比較例1～4 クリーム 下記表1及び表2に示す組成のクリーム（但し、実施例4は乳液）を製造し、得られたクリームを塗布した際の紫外線遮蔽効果、蚊の忌避効果、経時安定性及びに官能特性について評価した。

【0013】

【表1】

(%)

| (成分) | 実施例 | | | | |
|---------------------------------|------|------|------|------|------|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 |
| 1. ステアリン酸 | 1.5 | 2.0 | 3.0 | 0.2 | 7.0 |
| 2. セノール | 1.5 | 2.0 | 4.0 | 0.1 | 6.0 |
| 3. ベヘンアルコール | 1.0 | 3.0 | 3.0 | 0.1 | 4.0 |
| 4. 親油性モノステアリン酸グリセリン (HLB3.8) | 0.3 | 0.5 | 0.5 | — | 1.0 |
| 5. POE(80)硬化ヒマシ油(HLB15) | 0.5 | 1.0 | 1.5 | 0.2 | 1.5 |
| 6. 2-エチルヘキサン酸セチル | 8.0 | 10.0 | 10.0 | 1.0 | 10.0 |
| 7. 環状ジメチルシロキサン | 3.0 | 5.0 | 10.0 | 1.0 | 5.0 |
| 8. DEET | 5.0 | 15.0 | 10.0 | 1.0 | 5.0 |
| 9. シリコン処理微粒子酸化チタン(注1) | 5.0 | 5.0 | 7.0 | 1.0 | 12.0 |
| 10. 防腐剤 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 |
| 11. 香料 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 |
| 12. トリエタノールアミン | 0.8 | 1.1 | 1.5 | 0.3 | 3.5 |
| 13. 1,3-ブチレンジオール | 12.0 | 10.0 | 10.0 | 15.0 | 5.0 |
| 14. 加水分解コポリマー | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.3 | — |
| 15. 精製水 | 残量 | 残量 | 残量 | 残量 | 残量 |

注1: メカニカル・プロセスによる焼き付け処理

【0014】
【表2】

(%)

| (成分) | 比較例 | | | |
|---------------------------------|------|------|------|------|
| | 1 | 2 | 3 | 4 |
| 1. ステアリン酸 | 1.5 | 3.0 | 1.0 | 10.0 |
| 2. セノール | 2.0 | 4.0 | 0.5 | 6.0 |
| 3. ベヘンアルコール | 1.0 | 3.0 | 0.5 | 4.0 |
| 4. 親油性モノステアリン酸グリセリン (HLB3.8) | 0.3 | 0.5 | 0.1 | 1.0 |
| 5. POE(80)硬化ヒマシ油(HLB15) | 0.5 | 1.5 | 0.5 | 3.0 |
| 6. 2-エチルヘキサン酸セチル | 10.0 | 10.0 | 5.0 | 10.0 |
| 7. 環状ジメチルシロキサン | 5.0 | 5.0 | 10.0 | 8.0 |
| 8. DEET | — | 25.0 | 7.0 | 10.0 |
| 9. シリコン処理微粒子酸化チタン(注1) | 5.0 | 5.0 | — | 20.0 |
| 10. 防腐剤 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 |
| 11. 香料 | 適量 | 適量 | 適量 | 適量 |
| 12. トリエタノールアミン | 0.8 | 1.5 | 0.6 | 5.0 |
| 13. 1,3-ブチレンジオール | 12.0 | 10.0 | 15.0 | 5.0 |
| 14. 加水分解コポリマー | 0.2 | 0.2 | 0.2 | 0.1 |
| 15. 精製水 | 残量 | 残量 | 残量 | 残量 |

注1: メカニカル・プロセスによる焼き付け処理

【0015】(製法)

A: 成分1~11を70℃に加熱し、均一に混合する。
 B: 成分12~15を70℃に加熱し、均一に混合する。

C: BにAを添加して乳化混合し、冷却してクリームを得た。

【0016】[評価方法]

1. 紫外線遮蔽効果

25~35才の男性90名をパネルとし、各1品を10名の上腕に塗布して、その塗布部分にソーラーシュミレーターを用いて紫外線を照射したときの紅斑の程度を観察し、下記基準により紅斑スコアを求めた。

(紅斑スコア)

3: 紅斑は認められない。

2: 紅斑がわずかに認められる。

1: 紅斑が認められる。

0: 紅斑が認められ、皮膚表面がわずかにただれている。

【0017】2. 刺咬性害虫の忌避効果

25~42才の男性90名をパネルとし、各1品を10名の右上腕に塗布した。左上腕を対照とし、両腕を蚊の飼育ゲージに5分間露出したときの忌避効果を観察して、下記基準より刺咬スコアを求めた。

(刺咬スコア)

3: 非常に良好。

2: 良好。

1: やや良好。

0: 忌避効果なし。

【0018】3. 経時安定性評価

得られたクリームを50℃の恒温槽に放置し、1カ月後の状態を肉眼にて観察して下記評価基準にて評価した。

(評価基準)

◎：全く変化なし。
○：ほとんど変化なし。
△：分離の兆候が観察される。
×：二層に分離している。

【0019】4. 官能評価

18～32才の女性10名をパネルとし、伸びの良さ、べたつきのなさ並びにさっぱり感について官能評価を行った。下記評価基準で5段階評価し、さらにそれを平均して判定した。

(評価基準)

5点：非常に良好。

4点：良好。

3点：普通。

2点：やや不良。

1点：不良。

(判定)

◎：平均点4.5点以上。

○：平均点3.5点以上4.5点未満。

△：平均点2.5点以上3.5点未満。

×：平均点2.5点未満。

上記評価方法により得られた結果を表3に示す。

【0020】

【表3】

| (評価項目) | 実 施 例 | | | | | 比 較 例 | | | | |
|-------------|-------|---|---|---|---|-------|---|---|---|---|
| | 1 | 2 | 3 | 4 | 5 | 1 | 2 | 3 | 4 | |
| 紫外線遮蔽効果 | | | | | | | | | | |
| 紅斑スコア | 3 | 8 | 7 | 8 | 4 | 9 | 6 | 8 | 0 | 8 |
| | 2 | 2 | 3 | 2 | 6 | 1 | 3 | 2 | 0 | 2 |
| | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | 0 |
| | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 9 | 0 |
| 忌避効果 | | | | | | | | | | |
| 刺咬スコア | 3 | 5 | 7 | 8 | 3 | 9 | 0 | 9 | 7 | 8 |
| | 2 | 5 | 3 | 2 | 7 | 1 | 0 | 1 | 2 | 2 |
| | 1 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 1 | 0 | 1 | 0 |
| | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 0 | 9 | 0 | 0 | 0 |
| 経時安定性 評価 | | | | | | | | | | |
| | ◎ | ◎ | ◎ | ○ | ○ | ◎ | ○ | ○ | | △ |
| 官能評価 | | | | | | | | | | |
| 伸びの良さ | ◎ | ◎ | ○ | ◎ | ○ | ◎ | △ | ◎ | | △ |
| べたつきのなさ | ◎ | ◎ | ◎ | ◎ | ○ | ◎ | × | ◎ | | × |
| さっぱり感 | ◎ | ○ | ○ | ◎ | ○ | ◎ | × | ◎ | | × |

【0021】表3の結果から明らかなように、本発明に係わる実施例は、紫外線遮蔽効果、刺咬性害虫の忌避効果、経時安定性並びに官能特性のいずれにおいても優れ

たものであった。それに対し、比較例では全ての項目を満足するものではなかった。

【0022】

実施例6 クリーム

(成分)

| (成分) | (%) |
|------------------------------------|------|
| 1. ステアリン酸 | 2.5 |
| 2. ステアリルアルコール | 2.0 |
| 3. セタノール | 3.0 |
| 4. ソルビタンセスキオレエート (HLB3.7) | 0.5 |
| 5. POE-(20)-ソルビタンモノイソステレート (HLB15) | 1.0 |
| 6. スクワラン | 10.0 |
| 7. ジペンタエリトリット脂肪酸エステル | 0.5 |
| 8. DEET | 8.0 |
| 9. 微粒子酸化チタン | 6.0 |
| 10. 微粒子酸化亜鉛 | 1.0 |

| | |
|------------------------|------|
| 11. 防腐剤 | 適量 |
| 12. 香料 | 適量 |
| 13. トリエタノールアミン | 1.3 |
| 14. ジブロピレングルコール | 12.0 |
| 15. アルキル変性カルボキシビニルポリマー | 0.1 |
| 16. 精製水 | 残量 |

【0023】(製法)

A: 成分1~12を70℃に加熱し、均一に混合する。
 B: 成分13~16を70℃に加熱し、均一に混合する。

C: BにAを添加して乳化混合し、冷却してクリームを

得た。

実施例6は、日焼け防止効果及び刺咬性害虫の忌避効果に優れ、伸びが軽く、べたつきのないクリームであった。

【0024】

実施例7 リキッドファンデーション

| (成分) | (%) |
|-------------------------------|------|
| 1. ステアリン酸 | 4.0 |
| 2. セタノール | 2.0 |
| 3. ベヘニルアルコール | 1.0 |
| 4. 親油型モノステアリン酸グリセリン(HLB3.8) | 1.0 |
| 5. POE(20)ソルビタンモノオレエート(HLB15) | 2.0 |
| 6. ミリスチン酸イソプロピル | 5.0 |
| 7. 流動パラフィン | 8.0 |
| 8. DEET | 3.0 |
| 9. 防腐剤 | 適量 |
| 10. 酸化チタン | 5.0 |
| 11. タルク | 3.0 |
| 12. 着色顔料 | 1.0 |
| 13. トリエタノールアミン | 2.0 |
| 14. 1,3-ブチレングリコール | 10.0 |
| 15. カルボキシビニルポリマー | 0.1 |
| 16. 精製水 | 残量 |

【0025】(製法)

A: 成分1~9を70℃に加熱し、これに成分10~12を添加して均一に混合する。

B: 成分13~16を70℃に加熱し、均一に混合する。

C: BにAを添加して乳化混合し、これを冷却してリキッドファンデーションを得た。

実施例7は、日焼け防止効果及び刺咬性害虫の忌避効果に優れ、使用性も良好なリキッドファンデーションであった。

【0026】

【発明の効果】本発明の水中油型皮膚外用剤は、刺咬性害虫の忌避効果、紫外線遮蔽効果に優れ、良好な安定性並びに官能特性を有するものである。

XP-002132251

D-2

STN File Supplier, Karlsruhe (DE)
File CA COPYRIGHT 2000 ACS

| | |
|-----------|-----|
| P.D. | (2) |
| p. 1/2 = | |

AN 129:85847 CA
TI Oil-in-water skin cosmetics containing insect repellents and UV scattering agents
IN Inakawa, Takashi
PA Kosei Co., Ltd., Japan
SO Jpn. Kokai Tokkyo Koho, 6 pp.
CODEN: JKXXAF
DT Patent
LA Japanese
IC ICM A61K007-00
ICS A61K007-00; A01N037-18; A61K007-42; B01J013-00
CC 62-4 (Essential Oils and Cosmetics)
Section cross-reference(s): 5

JP 10-182344

FAN.CNT 1

| | PATENT NO. | KIND | DATE | APPLICATION NO. | DATE |
|----|---|------|----------|-----------------|--------------|
| PT | JP 10182344 | A2 | 19980707 | JP 1996-356993 | 19961226 <-- |
| AL | Title cosmetics contain biting insect (e.g. mosquito, flea, mite, etc.) repellents 1-20, UV scattering agents 1-15, hydrophilic surfactants with HLB .gtoreq.8 0.1-15, and higher alcs. 0.1-10 wt.%. Stearic acid 1.5, cetanol 1.5, behenyl alc. 1.0, glycerin monostearate 0.3, POE(80) hydrogenated castor oil 0.5, cetyl 2-ethylhexanoate 8.0, cyclic di-Me polysiloxane 3.0, DEET 5.0, silicone-treated TiO2 5.0, antiseptic, perfume, triethanolamine 0.8, 1,3-butylene glycol 12.0, carboxyvinyl polymer 0.2, and H2O to 100% were mixed to prep. a cream, which showed good UV shielding effect, mosquito repellency, and storage stability. | | | | |
| ST | oil in water cosmetic insect repellent; UV shielding cosmetic emulsion; hydrophilic surfactant cosmetic insect repellent; higher alc cosmetic insect repellent | | | | |
| IT | Polyoxyalkylenes, biological studies | | | | |
| | RL: BUU (Biological use, unclassified); BIOL (Biological study); USES (Uses) | | | | |
| | (hydrogenated castor oil derivs.; oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering agents) | | | | |
| IT | Surfactants | | | | |
| | (hydrophilic; oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering agents) | | | | |
| IT | Cosmetic emulsions | | | | |
| | Insect repellents | | | | |
| | Sunscreens | | | | |
| | UV shields | | | | |
| | (oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering agents) | | | | |
| IT | Ethoxylated hydrogenated castor oil | | | | |
| | Long-chain alcohols | | | | |
| | RL: BUU (Biological use, unclassified); BIOL (Biological study); USES (Uses) | | | | |
| | (oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering agents) | | | | |
| IT | 134-62-3, DEET | | | | |
| | RL: BAC (Biological activity or effector, except adverse); BUU (Biological use, unclassified); BIOL (Biological study); USES (Uses) | | | | |
| | (oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering agents) | | | | |

T. 112-92-5, 1-Octadecanol 661-19-8, Behenyl alcohol 1314-13-2, Zinc
oxide, biological studies 9005-65-6, Polyoxyethylene sorbitan monooleate,
13463-67-7, Titania, biological studies 25322-68-3D, hydrogenated castor
oil derivs. 36653-82-4, Cetanol 66794-58-9, Polyoxyethylene sorbitan
monoisostearate

RL: BUU (Biological use, unclassified); BIOL (Biological study); USES
(Uses)

(oil-in-water skin cosmetics contg. insect repellents and UV scattering
agents)